

BREVET D'INVENTION

CERTIFICAT D'UTILITÉ - CERTIFICAT D'ADDITION

COPIE OFFICIELLE

Le Directeur général de l'Institut national de la propriété industrielle certifie que le document ci-annexé est la copie certifiée conforme d'une demande de titre de propriété industrielle déposée à l'Institut.

Fait à Paris, le 30 DEC. 2002

Pour le Directeur général de l'Institut
national de la propriété industrielle
Le Chef du Département des brevets

Martine PLANCHE

DOCUMENT DE PRIORITÉ

PRÉSENTÉ OU TRANSMIS
CONFORMÉMENT À LA
RÈGLE 17.1.a) OU b)

INSTITUT
NATIONAL DE
LA PROPRIÉTÉ
INDUSTRIELLE

SIEGE
26 bis, rue de Saint Petersburg
75800 PARIS cedex 08
Téléphone : 33 (1) 53 04 53 04
Télécopie : 33 (1) 42 93 59 30
www.inpi.fr

REQUÊTE EN DÉLIVRANCE

page 1/2



Cet imprimé est à remplir lisiblement à l'encre noire

DB 540 W / 300301

Réservé à l'INPI

REMISE DES PIÈCES

DATE **27 DEC 2001**
LIEU **75 INPI PARIS**

N° D'ENREGISTREMENT **0116934**

NATIONAL ATTRIBUÉ PAR L'INPI

DATE DE DÉPÔT ATTRIBUÉE **27 DEC 2001**
PAR L'INPI

Vos références pour ce dossier

(facultatif) **BFF010420**

**1 NOM ET ADRESSE DU DEMANDEUR OU DU MANDATAIRE
À QUI LA CORRESPONDANCE DOIT ÊTRE ADRESSÉE**

CABINET PLASSERAUD

**84, rue d'Amsterdam
75440 PARIS CEDEX 09**

Confirmation d'un dépôt par télécopie

☐ N° attribué par l'INPI à la télécopie

2 NATURE DE LA DEMANDE

Cochez l'une des 4 cases suivantes

Demande de brevet

☒

Demande de certificat d'utilité

☐

Demande divisionnaire

☐

Demande de brevet initiale

N°

Date

ou demande de certificat d'utilité initiale

N°

Date

Transformation d'une demande de
brevet européen *Demande de brevet initiale*

☐

N°

Date

3 TITRE DE L'INVENTION (200 caractères ou espaces maximum)

**UTILISATION D'UNE POUDRE A LIBERATION IMMEDIATE DANS DES COMPOSITIONS PHARMACEUTIQUES ET
NUTRACEUTIQUES**

**4 DÉCLARATION DE PRIORITÉ
OU REQUÊTE DU BÉNÉFICE DE
LA DATE DE DÉPÔT D'UNE
DEMANDE ANTÉRIEURE FRANÇAISE**

Pays ou organisation

Date

N°

Pays ou organisation

Date

N°

Pays ou organisation

Date

N°

☐ S'il y a d'autres priorités, cochez la case et utilisez l'imprimé «Suite»

5 DEMANDEUR

☒ S'il y a d'autres demandeurs, cochez la case et utilisez l'imprimé «Suite»

Nom ou dénomination sociale

BESINS INTERNATIONAL BELGIQUE

Prénoms

Forme juridique

N° SIREN

Code APE-NAF

Société Anonyme

Adresse

Rue

Groot Bijgaardenstraat, 128 1620 DROGENBOS BELGIQUE

Code postal et ville

Pays

BELGIQUE

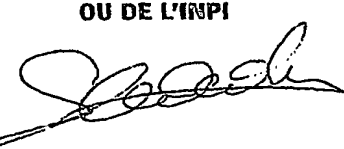
Nationalité

Belge

N° de téléphone (facultatif)

N° de télécopie (facultatif)

Adresse électronique (facultatif)

REMISE DES PIÈCES DATE 27 DEC 2001 LIEU 75 INPI PARIS N° D'ENREGISTREMENT 0116934 NATIONAL ATTRIBUÉ PAR L'INPI		Réservé à l'INPI	DB 540 W / 3003
Vos références pour ce dossier : <i>(facultatif)</i>		BFF010420	
6 MANDATAIRE Nom Prénom Cabinet ou Société N° de pouvoir permanent et/ou de lien contractuel Adresse Rue Code postal et ville N° de téléphone <i>(facultatif)</i> N° de télécopie <i>(facultatif)</i> Adresse électronique <i>(facultatif)</i>		Cabinet PLASSERAUD 84, rue d'Amsterdam 75009 PARIS	
7 INVENTEUR (S) Les inventeurs sont les demandeurs		<input type="checkbox"/> Oui <input checked="" type="checkbox"/> Non Dans ce cas fournir une désignation d'inventeur(s) séparée	
8 RAPPORT DE RECHERCHE Établissement immédiat ou établissement différé		Uniquement pour une demande de brevet (y compris division et transformation) <input checked="" type="checkbox"/> Établissement immédiat <input type="checkbox"/> Établissement différé	
Paiement échelonné de la redevance		Paiement en deux versements, uniquement pour les personnes physiques <input type="checkbox"/> Oui <input type="checkbox"/> Non	
9 RÉDUCTION DU TAUX DES REDEVANCES		Uniquement pour les personnes physiques <input type="checkbox"/> Requête pour la première fois pour cette invention <i>(joindre un avis de non-imposition)</i> <input type="checkbox"/> Requête antérieurement à ce dépôt <i>(joindre une copie de la décision d'admission pour cette invention ou indiquer sa référence)</i>	
Si vous avez utilisé l'imprimé «Suite», indiquez le nombre de pages jointes			
10 SIGNATURE DU DEMANDEUR OU DU MANDATAIRE (Nom et qualité du signataire) Cyra NARGOLWALLA 98-0506		VISA DE LA PRÉFECTURE OU DE L'INPI 	

REQUÊTE EN DÉLIVRANCE

Page suite N° .3. / ...

SUITE

Réservé à l'INPI

REMISE DES PIÈCES

DATE **27 DEC 2001**

LIEU **75 INPI PARIS**

N° D'ENREGISTREMENT **0116934**

NATIONAL ATTRIBUÉ PAR L'INPI

Cet imprimé est à remplir lisiblement à l'encre noire

DB 829 W / 140301

Vos références pour ce dossier (facultatif)

BFF010420

**4 DÉCLARATION DE PRIORITÉ
OU REQUÊTE DU BÉNÉFICE DE
LA DATE DE DÉPÔT D'UNE
DEMANDE ANTÉRIEURE FRANÇAISE**

Pays ou organisation
Date N°
Pays ou organisation
Date N°
Pays ou organisation
Date N°

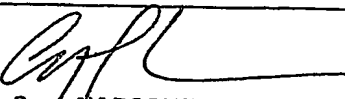
5 DEMANDEUR

Nom ou dénomination sociale **GALENIX INNOVATIONS**
Prénoms
Forme juridique **Société à Responsabilité Limitée**
N° SIREN
Code APE-NAF
Adresse
Rue **Europarc 14, rue G. Hertz 33600 PESSAC**
Code postal et ville
Pays **FRANCE**
Nationalité **Française**
N° de téléphone (facultatif)
N° de télécopie (facultatif)
Adresse électronique (facultatif)

5 DEMANDEUR

Nom ou dénomination sociale
Prénoms
Forme juridique
N° SIREN
Code APE-NAF
Adresse
Rue
Code postal et ville
Pays
Nationalité
N° de téléphone (facultatif)
N° de télécopie (facultatif)
Adresse électronique (facultatif)

**10 SIGNATURE DU DEMANDEUR
OU DU MANDATAIRE
(Nom et qualité du signataire)**


Cyril MARGOLWALLA
98-0506

**VISA DE LA PRÉFECTURE
OU DE L'INPI**

UTILISATION D'UNE POUDRE A LIBERATION IMMEDIATE DANS DES
COMPOSITIONS PHARMACEUTIQUES ET NUTRACEUTIQUES

La présente invention concerne l'utilisation d'une
5 poudre à libération immédiate pour application buccale
destinée à la préparation de compositions pharmaceutiques
ou nutraceutiques.

L'utilisation selon l'invention d'une poudre pour
préparer une composition pharmaceutique ou nutraceutique,
10 permet une libération rapide (ou « flash ») de la
substance active lorsque la composition la comprenant est
administrée par voie mucosale.

Des formes galéniques permettant une libération
rapide d'une substance active sont déjà connues. Il
15 s'agit de comprimés de type « lyoc » ou à délitement
rapide dans la bouche comme par exemple la technologie
FLASHTAB® (ETHYPHARM), SOBLET®, ou encore des systèmes de
type films présentés sous forme de « wafer », c'est-à-
dire des films pour application buccale permettant une
20 dissolution plus ou moins rapide des substances actives.

Ceci étant, ces deux formes galéniques présentent
plusieurs inconvénients. Les comprimés souffrent d'une
friabilité importante, ce qui rend délicate leur
manipulation et par ailleurs leur temps de délitement est
25 très souvent supérieur à 10 secondes. Les films sont
difficiles à appliquer du fait de leur très faible
épaisseur. En outre, les deux formes galéniques
souffrent d'un inconvénient majeur en ce qu'elles ne
permettent qu'une charge relativement faible en substance
30 active, des excipients divers et variés étant nécessaires
à leur intégrité structurale.

Les Sociétés Demanderesses ont donc cherché à développer une forme galénique pouvant pallier aux inconvénients rencontrés par les formulations antérieures.

5 Elles ont ainsi réussi à mettre au point une poudre dont l'utilisation dans une composition pharmaceutique ou nutraceutique permet une libération rapide et immédiate de la substance active seule ou en association, lorsque ladite composition est administrée par voie buccale.

10 Au sens de la présente invention, on entend par « libération rapide et immédiate » une libération de la totalité de la ou les substances actives en moins de 30 secondes, de préférence moins de 15, et plus préférentiellement encore en moins de 10 secondes.

15 La poudre utilisée selon l'invention, contrairement aux comprimés et films de l'art antérieur, n'est délicate ni dans sa manipulation ni dans son application. Elle permet en outre une charge importante en substance active. En effet la charge en substances actives par unité de prises peut être largement supérieure aux 20 mg imposés
20 notamment par la technologie des films de type « WAFER » ou équivalent.

L'utilisation de la poudre selon la présente invention présente donc de nombreux avantages par rapport
25 aux formes galéniques connues dans l'art antérieur.

Ainsi, la présente invention concerne l'utilisation d'une poudre comprenant au moins une substance active, au moins un agent tensioactif, au moins un agent mouillant, et au moins un agent diluant, pour la préparation d'une
30 composition pharmaceutique ou nutraceutique, cette composition permettant une libération rapide et immédiate

de la substance active lorsqu'elle est administrée par voie mucosale.

Les substances actives de la poudre utilisée selon l'invention peuvent être sélectionnées parmi celles classiquement utilisées dans les familles pharmacothérapeutiques suivantes : allergologie, anesthésie/réanimation, oncologie et hématologie, cardiologie et angiologie, contraception et interruption de grossesse, dermatologie, endocrinologie, gastro-entérohépatologie, gynécologie, immunologie, infectiologie, métabolisme et nutrition, neurologie/psychiatrie, ophtalmologie, oto-rhino-laryngologie, pneumologie, rhumatologie, stomatologie, toxicologie, urologie/néphrologie, ainsi que parmi les antalgiques et antispasmodiques, anti-inflammatoires, les produits de contraste utilisés en radiologie, les hémostatiques, et les produits de traitement du sang et dérivés.

Avantageusement, les substances actives peuvent être sélectionnées dans le groupe constitué par les substances actives passant la barrière mucosale et atteignant la circulation systémique, telles que l'acétate de cyprotérone, la Δ -4-androstènedione, le 3-kéto-désogestrel, le désogestrel, le gestodène, l'estradiol et ses dérivés, l'acétate de norethistérone, la progestérone, la testostérone, la dihydrotestostérone, la trinitrine, le fentanyl, la nitroglycérine, la nicotine (nicotine S(-)), la scopolamine, la clonidine, l'isosorbide dinitrate, le lévonorgestrel en association avec l'éthinylestradiol ou avec l'estradiol, l'androstanolone, l'alclométasone dipropionate, le

phlorglucinol, la molsidomine, ainsi que leurs associations.

Elles peuvent également être sélectionnées parmi les substances actives passant la barrière mucoale et ayant
 5 une action localisée telles que : l'acétazolamide, l'acyclovir, l'adapalène, l'alclométhasone dipropionate, l'amcinonide, l'améleine, le bamethan sulfate + escine, la bétaméthasone valérate, la bétaméthasone dipropionate, le bufexamac, la caféine, le calcipotriol monohydrate, le
 10 cetrimonium bromure, le clobétasol propionate, le crilanomère, la désonide, le dexpanthénol, le diclofénac, le diflucortolone, la valérate, le difluprednate, la diphényndramine chlorhydrate, l'econazole nitrate, l'erythromicine, le flumétasone pivalate, le fluocinolone
 15 acétonide, la fluocinodine, le fluocortolone, le fluocortolone hexanoate, le fluocortolone pivalate, l'hydrocortisone, l'hydrocortisone acétate, l'ibacitabine, l'ibuprofène, l'imiquimod, le kétoconazole, le kétoprofène, la lidocaïne, la
 20 métronidazole, le miconazole nitrate, le minoxidil, le niflumide acide, la penciclovir, le peroxyde benzoyle, la piroxam, la povidone iodé, la promestriène, la pyrazonibutasone, la roxithromycine, la sulfacétalmide, le triamconolone, le tazarotène, le trétinoïne et
 25 l'isotrétinoïne, le triclocarban, le vidarabine monophosphate ainsi que leurs associations.

Elles peuvent également être sélectionnées parmi les substances actives suivantes : l'agoniste β -3
 adrénergique, l'hormone de croissance, l'oxybutinine, la
 30 buprenorphine, le pergolide, le nestorone, le 7 α -méthyl-19-nortestérone, la mécamylamine, le salbutamol, la sélégiline, la buspirone, la kétotifen, la lidocaïne, le

kétorolac, l'eptazocine, l'insuline, l'interféron α , les
 prostaglandines, l'acide 5 aminolévulinique, la
 benzodiazepine alprozolam, le diclofenac, le fenoprofen,
 le flubiprofen, le kétoprofen, la méthylphénidate, la
 5 miconazole, le piroxicam, la bruprenorphine,
 l'alprozolam, la dexmedetomidine, la prazosin
 (antagoniste α adrénergique), l'alprostadil, le
 tulobutérol (agoniste β adrénergique), thinylestradiol +
 norelgestromi, le kétorolac, la physostigmine, le
 10 medindolol (agoniste α adrénergique), la rotigotine
 (dopamine D2 antagoniste), la thiatolserine ainsi que
 leurs associations.

Elles peuvent également être sélectionnées parmi les
 substances actives suivantes : Esomeprazole, Melagatran
 15 (en cas de thrombose), Rosuvastatine, Ezetimide,
 Pitavastatine (Hyperlipidémie), Mitiglinide (Diabète de
 type II), Cilomilast, Viozan (Asthme), Aripipazole
 (psychiatrie), Omapatrilat (hypertenseur), Orzel
 (Cancerologie), Caspofongine acétate, Voriconazole
 20 (infections), nouveaux Inhibiteurs COX tels que
 Etoricoxib (inflammation), Valdecoxib (Arthrites) et
 Parecoxib, Substance P antagoniste (Dépression),
 Darifenacine (urologie), Eletriptan (Migraine),
 Alosetron, Tegaserod, Capravirine (HIV) ainsi que leurs
 25 associations.

La poudre utilisée selon l'invention peut contenir
 un ou plusieurs principes actifs, en association entre
 eux.

Pour des applications nutraceutiques, la substance
 30 active peut être choisie parmi la liste des matières
 premières autorisées en tant que compléments alimentaires

comme par exemple dans le groupe constitué par les vitamines, les sels minéraux, la levure de bière, etc.

Selon un mode préférentiel de réalisation de la poudre selon l'invention, les substances actives sont
5 micronisées avant d'être mélangées aux autres ingrédients. Il est également possible de mélanger la substance active non-micronisée avec les autres ingrédients de la poudre et ensuite de microniser le mélange final. Ceci favorise une libération rapide (par
10 augmentation de la surface de contact avec la cavité buccale) et homogène de la substance active. Par ailleurs, les systèmes de pulvérisation de poudre sont particulièrement bien adaptés à la pulvérisation de produits micronisés.

15 La poudre utilisée selon l'invention peut également comprendre un ou des agents tensio-actifs, de préférence non ioniques, tels que le polyoxyéthylène sorbitan (ester d'acide gras), le polyoxyéthylène alkyl éther, le polyoxyéthylène dérivé de l'huile de ricin ainsi que
20 leurs mélanges.

En cas de besoin, cette poudre peut également comprendre un agent mouillant sélectionné dans le groupe constitué par les polyols tels que le sorbitol, ou encore la glycérine, le PEG ainsi que leurs mélanges.

25 La poudre utilisée selon l'invention peut également comprendre un liant sélectionné dans le groupe constitué par l'acacia, l'acide alginique, la carboxyméthylcellulose sodique, la cellulose microcristalline, les dextrines, l'éthylcellulose, la
30 gélatine, le glucose, la gomme guar, l'hydroxypropylméthylcellulose, la méthylcellulose,

l'oxyde de polyéthylène, la povidone, l'amidon
prégélatinisé, ainsi que leurs mélanges.

La poudre utilisée selon l'invention peut également
comprendre un agent diluant, sélectionné dans le groupe
5 constitué par le carbonate ou bicarbonate de calcium,
sodium, le sucrose, le mannitol, le xylitol, le sorbitol,
le lactose, la poudre de cellulose ou cellulose
microcristalline, l'amidon et ses dérivés, le phosphate
de calcium dibasique, le phosphate de calcium tribasique,
10 le sulfate de calcium, les dextrates, les dextrines, les
excipients de dextrose, le fructose, le kaolin, le
lactitol, ainsi que leurs mélanges.

La poudre utilisée selon l'invention peut
également comprendre un promoteur de pénétration qui peut
15 être sélectionné dans le groupe constitué par les esters
d'acide gras aliphatiques comme le myristate
d'isopropyle, les acides gras comme l'acide oléique ; les
alcools ou polyols tels que l'éthanol, le propylèneglycol
et le polyéthylèneglycol ; les composants des huiles
20 essentielles et dérivés terpéniques (comme l'eugenol, le
géraniol, le nérol, l'eucalyptol, le menthol) ; les
tensioactifs; les hydratants comme la glycérine, l'urée ;
des kératolytiques comme les alphahydroxyacides, le 23-
lauryl ether, l'aprotinin, l'azone, le chlorure de
25 benzalkonium, le chlorure de cétypyridinium, le
cétyltriméthylammonium bromide, les cyclodextrines, le
dextran sulfate, l'acide laurique, lauric acid, la
lysophosphatidylcholine, le menthol, le
méthoxysalicylate, le méthylolate, l'acide oléique, la
30 phosphatidylcholine, le polyoxyethylene, le polysorbate
80, l'EDTA de sodium, le glycocholate de sodium, le
glycodeoxycholate de sodium, le lauryl sulfate de sodium,

le salycilate de sodium, le taurocholate de sodium, le taurodeoxycholate de sodium, les sulfoxides, les alkyl glycosides.

5 Selon un mode préférentiel de réalisation de la poudre utilisée selon l'invention, elle présente une granulométrie comprise entre 0,01 μm et 1000 μm , de préférence entre 0,1 μm et 100 μm et plus préférentiellement encore entre 1 μm et 50 μm .

10 La composition contenant la poudre utilisée selon l'invention est administrée par voie mucosale. Elle peut être appliquée, par exemple, sur la muqueuse buccale, la muqueuse nasale ou la muqueuse vaginale, et également en application sublinguale.

15 De façon avantageuse, la composition comprenant la poudre utilisée selon l'invention, se présente sous une forme sèche conditionnée dans un pulvérisateur ou sous forme d'un sachet. Ces formulations permettent la délivrance aisée d'une dose précise de matière active.

20 Tous les procédés connus de l'homme du métier peuvent être utilisés dans le cadre de la réalisation de la poudre utilisée selon l'invention.

On peut citer comme exemple de méthode de préparation d'une poudre : la granulation, par voie humide ou par voie sèche, préférentiellement suivie
25 d'une micronisation.

Ou selon un autre mode de réalisation, la substance active est micronisée puis mélangée avec les excipients sous forme de poudre, et le mélange ainsi obtenu est granulé, par granulation par voie humide ou par voie
30 sèche.

Selon encore un autre mode de réalisation, la poudre utilisée selon l'invention peut être préparée par

atomisation. Les matières premières sont solubilisées dans un solvant puis la solution ou suspension résultant est atomisée. Le grain ainsi obtenu peut être utilisé directement ou après micronisation pour la préparation de la composition pharmaceutique ou nutraceutique administrée selon l'invention.

La substance active seule ou bien le mélange final d'ingrédients peuvent être micronisés.

L'invention sera mieux comprise à l'aide des exemples non-limitatifs décrits ci-dessous.

EXEMPLE 1 : POUDRES A UTILISER SELON L'INVENTION

On prépare quatre poudres présentant chacune la composition pondérale suivante :

15

Composition	Quantité en %
Phloroglucinol	10
Sorbitol	89
Propylène glycol	1

Composition	Quantité en %
Testostérone	10
Sorbitol	88
Crémophor RH40	2

Composition	Quantité en %
Dihydrotestostérone	5
Xylitol	90
Glycérol	3
Tween 80	2

Composition	Quantité en %
Molsidomine	10
Xylitol	83
Propylène glycol	5
Montanox 80	2

Les différents composants sont mélangés dans un mélangeur-granulateur de type mélangeur-granulateur-

20

sécheur sous vide ROTOLAB ZANCHETTA ou équivalent jusqu'à homogénéisation du mélange. Ensuite, une solution ou suspension de mouillage est incorporée sous agitation afin d'obtenir un granulé humide.

- 5 Ce granulé est ensuite séché dans des conditions adaptées afin d'évaporer le solvant de granulation. Ce granulé est ensuite séché et calibré puis micronisé à l'aide d'un appareil de micronisation à jet d'air de type ALPINE ou JETMIL (ou équivalent).

REVENDICATIONS

1. Utilisation d'une poudre comprenant au moins
5 une substance active, au moins un agent tensioactif, au
moins un agent mouillant, et au moins un agent diluant,
pour la préparation d'une composition pharmaceutique ou
nutraceutique, cette composition permettant une
libération rapide et immédiate de la substance active
10 lorsqu'elle est administrée par voie mucosale.

2. Utilisation d'une poudre selon la revendication
1, caractérisée en ce qu'au moins la substance active est
sous forme micronisée.

3. Utilisation d'une poudre selon l'une ou l'autre
15 des revendications 1 et 2, caractérisée en ce que la
poudre est sous forme micronisée.

4. Utilisation d'une poudre selon l'une quelconque
des revendications 1 à 3, caractérisée en ce que la
substance active est sélectionnée dans le groupe
20 constitué par l'estradiol et ses dérivés, l'acétate de
norethistérone, la progestérone, la testostérone, la
dihydrotestostérone, la trinitrine, le fentanyl, la
nitroglycérine, la nicotine (nicotine S(-)), la
scopolamine, la clonidine, l'isosorbide dinitrate, le
25 lévonorgestrel en association avec l'éthinylestradiol ou
avec l'estradiol, l'androstanolone, l'alclométasone
dipropionate, l'acetazolamide, l'acyclovir, l'adapalène,
l'alclométhasone dipropionate, l'amcinonide, l'améleïne,
le bamethan sulfate + escine, la bétaméthasone valérate,
30 la bétaméthasone dipropionate, le bufexamac, la caféine,
le calcipotriol monohydrate, le cetrimonium bromure, le
clobétasol propionate, le crilanomère, la désonide, le

dexpanthénol, le diclofénac, le diflucortolone, la
 valérate, le difluprednate, la diphényndramine
 chlorhydrate, l'econazole nitrate, l'erythromicine, le
 flumétasone pivalate, le fluocinolone acétonide, la
 5 fluocinodine, le fluocortolone, le fluocortolone
 hexanoate, le fluocortolone pivalate, l'hydrocortisone,
 l'hydrocortisone acétate, l'ibacitabine, l'ibuprofène,
 l'imiquimod, le kétoconazole, le kétoprofène, la
 lidocaïne, la métronidazole, le miconazole nitrate, le
 10 minoxidil, le niflumide acide, la penciclovir, le
 peroxyde benzoyle, la piroxam, la povidone iodé, la
 promestriène, la pyrazonibutasone, la roxithromycine, la
 sulfacétalmide, le triamconolone, le tazarotène, le
 trétinoïne et l'isotrétinoïne, le triclocarban, le
 15 vidarabine monophosphate, l'agoniste β -3 adrénergique,
 l'hormone de croissance, l'oxybutinine, la buprenorphine,
 le pergolide, l'estradiol + nestorone, le nestorone, le
 7 α -méthyl-19-nortestérone, la mécamylamine (antagoniste
 de la nicotine) + nicotine, le salbutamol, la
 20 sélégiline, la buspirone, la kétotifen, la lidocaïne, la
 testostérone + estradiol, le kétorolac, l'eptazocine,
 l'insuline, l'interféron α , les prostaglandines, le 17 β
 estradiol + norethindrone acétate, l'acide 5
 aminolévulinique, la benzodiazepine alprozolam, le
 25 diclofenac, le fenoprofen, le flubiprofen, le kétoprofen,
 la méthylphénidate, la miconazole, le piroxicam, la
 bruprenorphine, l'alprozolam, la dexmedetomidine, la
 prazosin (antagoniste α adrénergique), le gestodène +
 éthinylestradiol, l'alprostadil, le tulobutérol (agoniste
 30 β adrénergique), l'éthinylestradiol + norelgestromin, le
 kétorolac, la physostigmine, la lidocaïne, le medindolol
 (agoniste α adrénergique), la rotigotine (dopamine D2

antagoniste), l'éthinylestradiol + noréthindrone acétate, la thiatolserine, le phlorglucinol, la molsidomine, l'esomeprazole, le melagatran (en cas de thrombose), la rosuvastatine, l'ezetimide, la pitavastatine
 5 (Hyperlipidémie), le mitiglinide (Diabète de type II), Cilomilast, Viozan (Asthme), l'aripipazole (psychiatrie), l'omapatrilat (hypertenseur), l'orzel (Cancerologie), la caspofongine acétate, le voriconazole (infections), les nouveaux Inhibiteurs COX tels que l'etoricoxib
 10 (inflammation), le valdecoxib (Arthrites) et le parecoxib, la substance P antagoniste (Dépression), la darifenacine (urologie), l'eletriptan (Migraine), l'alosetron, le tegaserod, la capravirine (HIV), ainsi que leurs associations.

15 5. Utilisation d'une poudre selon l'une quelconque des revendications 1 à 3, caractérisée en ce que la substance active est sélectionnée dans le groupe constitué par les vitamines, les sels minéraux, la levure de bière.

20 6. Utilisation d'une poudre selon l'une quelconque des revendications 1 à 5, caractérisée en ce que l'agent tensioactif est sélectionné de préférence parmi les tensioactifs non ioniques tels que le polyoxyéthylène sorbitan (ester d'acide gras), le polyoxyéthylène alkyl
 25 éther, le polyoxyéthylène dérivé de l'huile de ricin, ainsi que leurs mélanges.

7. Utilisation d'une poudre selon l'une quelconque des revendications 1 à 6, caractérisée en ce que l'agent mouillant est sélectionné dans le groupe constitué par
 30 les polyols tels que le sorbitol, la glycérine, le polyéthylèneglycol, ainsi que leurs mélanges.

8. Utilisation d'une poudre selon l'une quelconque des revendications 1 à 7, caractérisée en ce que l'agent diluant est sélectionné dans le groupe constitué par le carbonate ou bicarbonate de calcium, sodium, le sucre, le mannitol, le xylitol, le sorbitol, le lactose, la poudre de cellulose ou cellulose microcristalline, l'amidon et ses dérivés, le phosphate de calcium dibasique, le phosphate de calcium tribasique, le sulfate de calcium, les dextrates, les dextrines, les excipients de dextrose, le fructose, le kaolin, le lactitol, ainsi que leurs mélanges.

9. Utilisation d'une poudre selon l'une quelconque des revendications 1 à 8, caractérisée en ce qu'elle comprend en outre un agent liant pouvant être sélectionné dans le groupe constitué par l'acacia, l'acide alginique, la carboxyméthylcellulose sodique, la cellulose microcristalline, les dextrines, l'éthylcellulose, la gélatine, le glucose, la gomme guar, l'hydroxypropylméthylcellulose, la méthylcellulose, l'oxyde de polyéthylène, la povidone, l'amidon pré-gélatinisé, ainsi que leurs mélanges.

10. Utilisation d'une poudre selon l'une quelconque des revendications 1 à 9, caractérisée en ce qu'elle comprend en outre un promoteur de pénétration pouvant être sélectionné dans le groupe constitué par les esters d'acide gras aliphatiques comme le myristate d'isopropyle; les acides gras comme l'acide oléique; les alcools ou polyols tels que l'éthanol, le propylèneglycol et le polyéthylèneglycol; les composants des huiles essentielles et dérivés terpéniques (comme l'eugénol, le géraniol, le nérol, l'eucalyptol, le menthol); les tensioactifs; les hydratants comme la glycérine, l'urée;

des kératolytiques comme les alphahydroxyacides, le 23-lauryl ether, l'aprotinin, l'azone, le chlorure de benzalkonium, le chlorure de cétypyridinium, le cétyltriméthylammonium bromide, les cyclodextrines, le
5 dextran sulfate, l'acide laurique, lauric acid, la lysophosphatidylcholine, le menthol, le méthoxysalicylate, le méthylolate, l'acide oléique, la phosphatidylcholine, le polyoxyethylene, le polysorbate 80, l'EDTA de sodium, le glycocholate de sodium, le
10 glycodeoxycholate de sodium, le lauryl sulfate de sodium, le salicylate de sodium, le taurocholate de sodium, le taurodeoxycholate de sodium, les sulfoxides, les alkyl glycosides, ainsi que leurs mélanges.

11. Utilisation d'une poudre selon l'une quelconque
15 des revendications 1 à 10, caractérisée en ce qu'elle présente une granulométrie comprise entre 0,01 μm et 1000 μm , de préférence entre 0,1 μm et 100 μm et plus préférentiellement encore entre 1 μm et 50 μm .

12. Utilisation d'une poudre selon l'une quelconque
20 des revendications 1 à 11, caractérisée en ce qu'elle est appliquée sur la muqueuse buccale, la muqueuse nasale ou la muqueuse vaginale.

13. Utilisation d'une poudre selon la revendication
12, caractérisée en ce qu'elle est appliquée sur la
25 muqueuse buccale par voie sublinguale.

14. Utilisation d'une poudre selon l'une quelconque
des revendications 1 à 13, caractérisée en ce qu'elle se présente sous une forme pulvérisable.

15. Utilisation d'une poudre selon l'une quelconque
30 des revendications 1 à 13, caractérisée en ce qu'elle se présente sous forme d'un sachet.

DÉPARTEMENT DES BREVETS

26 bis, rue de Saint Pétersbourg
75800 Paris Cedex 08

Téléphone : 33 (1) 53 04 53 04 Télécopie : 33 (1) 42 94 86 54

DÉSIGNATION D'INVENTEUR(S) Page N° ... / ...

(Si le demandeur n'est pas l'inventeur ou l'unique inventeur)



Cet imprimé est à remplir lisiblement à l'encre noire

DB 113 W / 3003K

Vos références pour ce dossier (facultatif)		FR 01 16934	
N° D'ENREGISTREMENT NATIONAL		01 16934	
TITRE DE L'INVENTION (200 caractères ou espaces maximum)			
UTILISATION D'UNE POUDRE A LIBERATION IMMEDIATE DANS DES COMPOSITIONS PHARMACEUTIQUES ET NUTRACEUTIQUES			
LE(S) DEMANDEUR(S) :			
BESINS INTERNATIONAL BELGIQUE GALENIX INNOVATIONS			
DESIGNE(NT) EN TANT QU'INVENTEUR(S) : (Indiquez en haut à droite «Page N° 1/1» S'il y a plus de trois inventeurs, utilisez un formulaire identique et numérotez chaque page en indiquant le nombre total de pages).			
Nom		BESSE Jérôme	
Prénoms			
Adresse	Rue	Chemin des Vins Barbat 33480 LISTRAC	
	Code postal et ville	MEDOC	
Société d'appartenance (facultatif)			
Nom		BESSE Laurence	
Prénoms			
Adresse	Rue	Chemin des Vins Barbat 33480 LISTRAC	
	Code postal et ville	MEDOC	
Société d'appartenance (facultatif)			
Nom			
Prénoms			
Adresse	Rue		
	Code postal et ville		
Société d'appartenance (facultatif)			
DATE ET SIGNATURE(S) DU (DES) DEMANDEUR(S) OU DU MANDATAIRE (Nom et qualité du signataire)		Le 21 Février 2002 CABINET PLASSERAUD Cyra NARGOLWALLA 98-0506 